

Состав

действующее вещество: финастерид;

1 таблетка содержит финастерид 5 мг;

другие составляющие: лактоза, моногидрат; крахмал прежелатинизированный; целлюлоза микрокристаллическая; натрия крахмалгликолят; натрия докузат; магния стеарат; Opadry Blue 03A80928 (гипромеллоза, титана диоксид (Е 171), тальк, индигокармин алюминиевый лак (Е 132), железа оксид желтый (Е 172)).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы, голубого цвета, покрытые пленочной оболочкой, с надписью Н с одной стороны и 37 с другой стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые при доброкачественной гипертрофии предстательной железы. Код АТХ G04C B01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Финастерид – это специфический ингибитор 5-альфа-редуктазы типа II, внутриклеточного фермента, который превращает тестостерон в более активный дигидротестостерон андроген (ДГТ). При доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ) ее увеличение зависит от превращения тестостерона в ДГТ в тканях простаты. Финастерид высокоэффективно снижает как циркулирующий, так и внутрипростатический ДГТ. Финастерид не имеет родства с рецепторами андрогенов.

В клинических исследованиях с участием пациентов, которые имели умеренные и тяжелые проявления ДГПЖ, увеличенную предстательную железу при пальцевом ректальном обследовании и низким остаточным объемом мочи, Бинфин уменьшил частоту острой задержки мочи с 7/100 до 3/100 за 4 года и вмешательство (трансуретрорезекции предстательной железы и простатэктомии) с 10/100 до 5/100. Это уменьшение сопровождалось улучшением на 2 пункта по шкале оценки симптомов QUASI-AUA (диапазон 0-34), значительной регрессией

объема простаты примерно на 20% и значительным увеличением скорости потока мочи.

Исследование MTOPS (Медицинское лечение простатических симптомов) было 4-6-летним исследованием с участием 3047 мужчин с симптоматической ДГПЖ, которые были рандомизированы до приема финастерида, 5 мг/сут, доксазосин, 4 или 8 мг/сут, комбинации финастерида, 5 сутки и доксазосин, 4 или 8 мг/сут, или плацебо. Первичной конечной точкой наблюдения было время до клинического прогрессирования ДГПЖ (которое определялось как увеличение от начала на 4 и более пунктов по шкале оценки симптомов, эпизод острой задержки мочи, связанная с ДГПЖ почечная недостаточность, рецидив инфекции мочевыводящих путей или уросепсис). По сравнению с плацебо лечение финастеридом, доксазосином или комбинацией привело к значительному снижению риска клинического прогрессирования ДГПЖ соответственно на 34% ($p=0,002$), 39% ($p<0,001$) и 67% ($p<0,001$). Большинство случаев (274 из 351), составлявших прогрессирование ДГПЖ, было подтверждено увеличением на ≥ 4 пункта по шкале оценки симптомов; под влиянием лечения риск прогрессирования симптомов был снижен на 30% (95% интервал доверия 6-48%), 46% (95% интервал доверия 25-60%) и 64% (95% интервал доверия 48-75%) соответственно в группах приема финастерида, доксазосин и комбинации по сравнению с плацебо. Острая задержка мочеиспускания наблюдалась в 41 из 351 случаев прогрессирования ДГПЖ; под влиянием лечения риск развития острой задержки мочеиспускания был снижен на 67% ($p=0,011$), 31% ($p=0,296$) и 79% ($p=0,001$) соответственно в группах приема финастерида, доксазосин и комбинации по сравнению с плацебо. Только группы приема финастерида и комплексной терапии имели существенную разницу с группой приема плацебо.

Фармакокинетика.

У мужчин после перорального приема дозы финастерида, меченного изотопами углерода ^{14}C , 39% принятой дозы выделялось с мочой в форме метаболитов (вероятно, с мочой выделялось также незначительное количество неизмененного финастерида). 57% принятой дозы выводилось с калом. Исследованиями также установлено, что двум метаболитам финастерида присуще менее выраженное угнетающее действие по отношению к 5-альфа-редуктазе. Биодоступность финастерида при пероральном приеме составляет около 80%. Прием пищи не влияет на биодоступность препарата. Максимальная концентрация финастерида в плазме крови достигается через 2 ч после перорального приема. Абсорбция препарата из желудочно-кишечного тракта истекает через 6-8 часов после его приема. Период полувыведения финастерида в плазме крови составляет в среднем 6 часов. Связывание с белками плазмы крови – 93%. Системный клиренс составляет примерно 165 мл/мин, объем распределения – 76,1 литра.

В пожилом возрасте скорость выведения финастерида несколько снижается. У мужчин старше 70 лет период полувыведения финастерида составляет примерно 8 часов, тогда как у лиц в возрасте от 18 до 60 лет – 6 часов. Но это не показание для уменьшения дозы препарата у лиц старшего возраста.

У пациентов с ХПН (клиренс креатинина от 9 до 55 мл/мин) не выявлено разности скорости выведения однократной дозы финастерида, меченного изотопами углерода ^{14}C , по сравнению со здоровыми добровольцами. Связывание с белками плазмы крови у этих групп пациентов также не отличалось. Это объясняется тем, что у пациентов с почечной недостаточностью доля метаболитов финастерида, которая в нормальных условиях выделяется с мочой, выводится с калом. Это подтверждается увеличением у этих пациентов количества метаболитов финастерида в кале при одновременном понижении их концентрации в моче. Поэтому для пациентов с почечной недостаточностью, которым не показан гемодиализ, коррекция дозы препарата не требуется.

Данные о фармакокинетике у пациентов с печеночной недостаточностью отсутствуют.

Финастерид проникает через гематоэнцефалический барьер. Небольшое количество финастерида обнаруживали в семенной жидкости.

Показания

Лечение и контроль доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ) у пациентов с увеличенной предстательной железой с целью:

уменьшение размеров (регрессии) увеличенной железы, улучшение оттока мочи и уменьшение симптомов, связанных с ДГПЖ;

снижение риска возникновения острой задержки мочи и необходимости хирургического вмешательства, в том числе трансуретрорезекции предстательной железы и простатэктомии.

Противопоказания

Повышение чувствительности к финастериду или любому компоненту этого препарата.

Бинфин не показан для применения женщинам и детям.

Период беременности или если пациентка может быть беременной (см. раздел «Применение в период беременности или кормления грудью»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Не выявлено клинически значимого взаимодействия с другими препаратами. Бинфин не оказывает заметного влияния на ферментную систему, которая метаболизирует препараты, связанные с цитохромом Р 450. Хотя риск того, что финастерид влияет на фармакокинетику других лекарственных средств, оценивается как небольшой, существует вероятность того, что ингибиторы и индукторы цитохрома Р 4 будут влиять на концентрацию финастерида в плазме крови. Однако, учитывая установленные показатели безопасности, любое повышение концентрации финастерида в связи с одновременным применением ингибиторов цитохрома Р450 3А4 вряд ли будет иметь клиническое значение. Проверенные на людях соединения включают пропранолол, дигоксин, глибурид, варфарин, теофиллин и антипирин; при этом не было найдено клинически значимых взаимодействий.

Особенности по применению

Общие мероприятия

Необходимо тщательный контроль за возможным развитием обструктивной уropатии у пациентов с большим остаточным объемом мочи и/или резко сниженным течением мочи.

Воздействие на простатоспецифический антиген (ПСА) и диагностику рака предстательной железы

До сих пор не показано благоприятного клинического влияния на лечение Бинфином у пациентов, больных раком предстательной железы. Пациенты с аденомой предстательной железы и повышенным уровнем ПСА наблюдались в контролируемых клинических исследованиях с несколькими определениями ПСА и взятием биопсии предстательной железы. В этих исследованиях лечение Бинфином не влияло на частоту выявления рака предстательной железы. Общая частота рака предстательной железы существенно не отличалась в группах пациентов, получавших Бинфин или плацебо.

Перед началом лечения и периодически во время лечения Бинфином рекомендуется проверять пациентов путем ректального исследования, а также другими методами на предмет рака предстательной железы. Определение сывороточного ПСА также используется для обнаружения рака простаты. В общем, при базовом уровне ПСА более 10 нг/мл (Hybritech) следует проводить тщательное обследование пациента, включая, при необходимости, проведение биопсии. При уровне ПСА в пределах 4–10 нг/мл рекомендуется дальнейшее обследование пациента. Существует значительное совпадение в уровнях ПСА у

мужчин, болеющих раком предстательной железы и не имеющих этого заболевания. Следовательно, у мужчин, больных аденомой предстательной железы нормальные значения ПСА не позволяют исключить рак предстательной железы, независимо от лечения Бинфином. Базисный уровень ПСА ниже 4 нг/мл не исключает рака простаты.

Бинфин приводит к уменьшению содержания сывороточного ПСА примерно на 50% у пациентов, страдающих аденомой предстательной железы, даже при наличии рака простаты. Это снижение уровня сывороточного ПСА у пациентов с аденомой предстательной железы, получающих лечение Бинфином, необходимо принять во внимание при оценке уровня ПСА, поскольку это снижение не исключает сопутствующего рака простаты. Это снижение предсказуемо во всем диапазоне значений уровня ПСА, хотя это может колебаться у отдельных пациентов. У большинства пациентов, получающих Бинфин в течение 6 месяцев и более, значения ПСА должны быть удвоены по сравнению с нормой у лиц, не принимающих лечение. Такая коррекция позволяет сохранить чувствительность и специфичность определения ПСА и поддерживает его способность выявлять рак предстательной железы.

При любом длительном повышении уровня ПСА у пациента, получающего лечение финастеридом 5 мг, необходимо тщательное обследование для выяснения причин, включая несоблюдение режима приема Бинфина.

Воздействие препарата на лабораторные данные

Воздействие на уровень ПСА

Уровень ПСА в сыворотке крови коррелирует с возрастом пациента и объемом простаты, при этом объем простаты коррелирует с возрастом пациента. При оценке лабораторных показателей ПСА необходимо учитывать тот факт, что уровень ПСА снижается в процессе лечения Бинфином. У большинства пациентов наблюдается быстрое снижение ПСА в первые месяцы лечения, после чего уровень ПСА стабилизируется на новом уровне, который составляет примерно половину от базисной величины. Из этого осмотра у типичных пациентов, получающих Бинфин в течение 6 месяцев и более, значения ПСА должны быть удвоены по сравнению с нормой значения у лиц, не принимающих лечение.

Бинфин существенно не уменьшает процент свободного ПСА (отношение свободного ПСА к общему). Отношение свободного и общего ПСА остается постоянным даже под влиянием препарата Бинфин. При определении процента свободного ПСА, применяемого для диагностики рака простаты, корректировка его значений не обязательна.

Рак молочной железы у мужчин

Во время клинических исследований и в постмаркетинговый период сообщали о раке молочной железы у мужчин, принимавших финастерид, 5 мг. Врачи должны проинструктировать своих пациентов о необходимости немедленного сообщения о любых изменениях в тканях молочной железы, а именно о припухлости, боли, гинекомастии или выделении из сосков.

Лактоза

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует применять препарат Бинфин.

Печеночная недостаточность

Влияние печеночной недостаточности на фармакокинетику финастерида не исследовали.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Применение в период беременности.

Бинфин противопоказан беременным женщинам.

Женщины, которые потенциально могут забеременеть или беременные должны избегать контакта с измельченными таблетками Бинфина или потерявшими целостность.

Имеются данные о выделении небольшого количества финастерида из спермы пациента, принимавшего финастерид 5 мг/сут. Неизвестно, может ли на плод мужского пола негативно повлиять то, что на его мать влияла сперма пациента, лечившегося финастеридом. Если половая партнерша пациента есть или может потенциально быть беременной, пациенту рекомендуется предотвращать влияние спермы на партнершу.

Из-за способности ингибиторов 5-альфа-редуктазы типа II тормозить превращение тестостерона в дигидротестостерон эти препараты, включая финастерид, могут вызвать нарушения в развитии наружных половых органов у плода мужского пола.

Таблетки Бинфина покрыты оболочкой и это предотвращает контакт с активным ингредиентом при условии, что таблетки не измельчены и не утратили целостность.

Применение в период кормления грудью.

Бинфин не показан женщинам. Неизвестно, проникает ли финастерид в молоко матери.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Не влияет на способность управлять автомобилем и работу с механизмами.

Способ применения и дозы

Рекомендуемая доза – 1 таблетка по 5 мг 1 раз в сутки, независимо от приема пищи.

Бинфин можно применять в качестве монотерапии в комбинации с альфа-блокатором доксазозином (см. раздел «Фармакологические свойства»).

Срок лечения определяет врач индивидуально. Несмотря на то, что улучшение симптоматики может наблюдаться раньше, для оценки эффективности действия необходимо по меньшей мере шестимесячный прием препарата, после чего необходимо продолжить лечение.

Для пациентов пожилого возраста и больных почечной недостаточностью различной степени (снижение клиренса креатинина до 9 мл/мин) коррекция дозы не требуется.

Нет данных о применении препарата пациентам с нарушениями функции печени.

Не использовать детям.

Дети

Бинфин противопоказан детям.

Безопасность и эффективность применения препарата детям не установлены.

Передозировка

У пациентов, получавших Бинфин в дозе до 400 мг однократно и Бинфин в дозе до 80 мг в сутки в течение 3 месяцев, какие-либо нежелательные эффекты отсутствовали.

Не существует специальных рекомендаций по лечению при передозировке Бинфином.

Побочные эффекты

Наиболее частыми побочными реакциями являются импотенция и снижение либидо. Эти побочные реакции возникают в начале курса терапии и проходят при дальнейшем лечении у большинства пациентов.

Побочные реакции, о которых сообщали во время клинических исследований и/или постмаркетингового применения, указаны ниже в таблице.

Частота побочных реакций определена как: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100 - < 1/10$), редко ($\geq 1/1000 - < 1/100$), редко ($\geq 1/10000 - < 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (нельзя подсчитать по имеющимся данным). Частоту появления побочных реакций, о которых сообщалось во время постмаркетингового применения, нельзя определить, поскольку они получены по спонтанным сообщениям.

Система органов	Частота проявлений
Со стороны иммунной системы	Неизвестно: реакции повышенной чувствительности, включая зуд, крапивницу и отек Квинке (в том числе отек губ, языка, горла и лица)
Со стороны психики	Часто: понижение либидо. Неизвестно: понижение либидо, которое может продолжиться после прекращения терапии, депрессия, тревожность.
Со стороны сердечной системы	Неизвестно: учащенное сердцебиение.
Со стороны печени и желчевыводящих путей	Неизвестно: повышен уровень ферментов печени.

Со стороны кожи и подкожных тканей.	Нечасто: сыпь. Неизвестно: зуд, крапивница.
Со стороны репродуктивной системы и молочных желез	Часто: импотенция. Нечасто: расстройство эякуляции, болезненность и увеличение молочных желез. Неизвестно: боли в яичках, гематоспермия, эректильная дисфункция, которая может продолжаться после прекращения лечения; мужское бесплодие и/или обратимые нарушения качества спермы (о нормализации или улучшении качества спермы сообщалось после прекращения приема финастерид).
По исследованиям	Часто: уменьшение эякулята.

Кроме того, в клинических исследованиях и постмаркетинговом применении сообщали о раке молочной железы у мужчин, принимавших финастерид. Следует немедленно сообщить врачу о любых изменениях в тканях молочной железы, а именно: припухлость, боль, гинекомастию или выделение из сосков. При сравнении профилей безопасности монотерапии финастеридом (5 мг/сут) и доксазозином (4 или 8 мг/сут) с комбинированной терапией финастеридом (5 мг/сут) и доксазозином (4 или 8 мг/сут) и плацебо оказалось, что профиль безопасности и переносимости комбинированной терапии соответствовали профилю безопасности отдельных компонентов. Частота проявлений расстройств со стороны эякуляции у пациентов, принимавших комбинированную терапию, сравнима с суммой частоты проявлений побочных реакций двух монотерапий. Информация о связи между длительным применением финастерида и опухолями с баллами Глисона 7-10 отсутствует. Данные лабораторных анализов При оценке лабораторных исследований простатоспецифического антигена (ПСА) следует учитывать, что уровень ПСА снижается у пациентов, принимающих Бинфин. У большинства пациентов быстрое снижение ПСА наблюдается в первые месяцы терапии, после чего уровень ПСА стабилизируется до нового начального уровня. Начальный уровень после лечения составляет примерно половину значения для лечения.

Поэтому у большинства пациентов, принимающих Бинфин в течение 6 месяцев или более, значение ПСА следует удваивать для сравнения с нормальными диапазонами у мужчин, которые не лечились. При проведении стандартных лабораторных тестов другие различия между пациентами, получавшими Бинфин, и пациентами, получавшими Плацебо, отсутствовали.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° С в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 15 таблеток, покрытых пленочной оболочкой, в блистере.

По 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

За рецептом.

Производитель

Гетеро Лабз Лимитед/Hetero Labs Limited.

Адрес

Юнит III, Формулейшн Забор № 22 - 110 ИДА, Джидиметла, Хайдерабад, 500 055
Телангана, Индия/Unit III, Formulation Plot No 22 - 110 IDA, Jeedimetla,
Hyderabad, 500 055 Telang